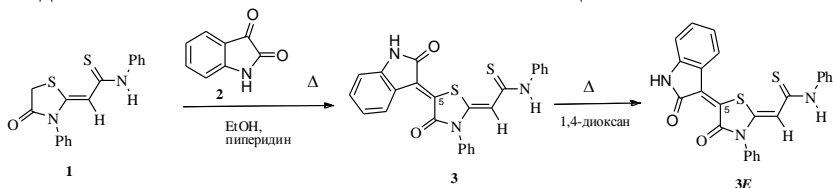


СИНТЕЗ АНСАМБЛЕЙ ГЕТЕРОЦИКЛОВ НА ОСНОВЕ 4-ОКСОТИАЗОЛА И ИЗАТИНА

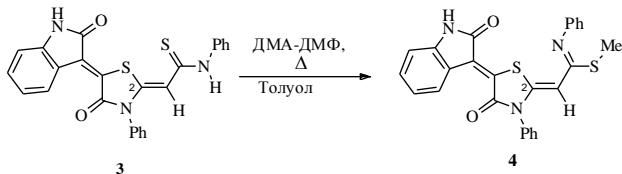
Галуцинский А.Н., Обьеденнов К.Л., Костерина М.Ф., Моржерин Ю.Ю.
Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

В последнее время интерес представляет синтез производных 2-этилидентиазолидин-4-она, содержащих такие фармакофорные группы, как тиазольные, бензотиазольные, бензимидазольные и другие гетероциклы, так как некоторые из них проявили высокую селективную анти-малярийную и противоопухолевую активности [1, 2]. Кроме того, тиамидная группа придает соединениям конформационную стабилизацию, как за счет водородных связей [3], так и специфических взаимодействий, в которые вовлекается тиаомидный фрагмент [4]. Поэтому целью данной работы стал синтез производных 4-оксотиазолидин-2,5-илиденов, содержащих тиаомидную группу и 2-оксоиндольный фрагмент.

На первой стадии мы получили (Z)-2-((Z)-4-оксо-5-(2-оксоиндолин-3-илиден)-3-фенилтиазолидин-2-илиден)-N-фенилэнтентиаомид **3** реакцией тиазола **1** с изатином **2** с выходом 75%, причем мы наблюдали образование только одного изомера. Однако, при длительном кипячении продукта **3** в диоксане происходит изомеризация по двойной связи в 5-ом положении тиазольного цикла.



Для дальнейшей модификации тиазолидина **3** мы провели метилирование по тиаомидной группе при помощи ДМА-ДМФ, в результате чего был выделен продукт метилирования **4** с выходом 40%.



В спектре ЯМР ^1H соединения **4** мы наблюдали смещение сигнала водорода при двойной экзоциклической связи во 2-ом положении тиа-

зольного цикла в область сильного поля по сравнению с исходным тиазолом.

Таким образом, в ходе данной работы нами были получены ансамбли гетероциклов на основе 4-оксотиазола и изатина. Показана возможность изомеризации 4-оксотиазолидин-2,5-илидена по двойной связи в 5-ом положении тиазольного кольца.

1. Takasu K., Inoue H., Kim H. S. et al. // J. Med. Chem. 2002. V. 45. P. 995.
2. Wang S., Zhao Y., Zhu W. et al. // Arch. Pharm. Chem. Life Sci. 2012. V. 345. P. 73.
3. Gorske B.C., Nelson R.C., Bowden Z.S. et al. // Org. Chem. 2013. V. 78. P. 11172.
4. Baranac-Stojanović M., Klaumünzer U., Marković R. et al. // Tetrahedron. 2010. V. 66. P. 8958.

МАЛОНДИТИОАМИДЫ В СИНТЕЗЕ 4-ОКСОТИАЗОЛИДИН-2,5-ИЛИДЕНОВ

Головко Н.А., Обыденнов К.Л., Костерина М.Ф., Моржерин Ю.Ю.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Производные 4-оксотиазола привлекают внимание благодаря широкому спектру биологической активности [1]. Целью данной работы стал синтез производных 2-(4-оксотиазолидин-2-илиден)энтентиамида, несущих бензилиденовый фрагмент.

Синтез (Z)-2-(4-оксо-3-арилтиазолидин-2-илиден)-N-арилэнтентиамидов **2a-c** осуществлялся по реакции Ганча. Так, кипячение N,N'-диарилмалондитиоамидов **1a-c** и хлоруксусного эфира в этаноле или изопропиловом спирте с добавлением ацетата натрия в качестве основания протекает с образованием продукта гетероциклизации только по одной тиоамидной группе - (Z)-2-(4-оксо-3-арилтиазолидин-2-илиден)-N-арилэнтентиамидов **2a-c** с выходами 50-70%.